

**N-SUBSTITUTED INDOLE DERIVATIVE, METHOD FOR PRODUCING THE SAME,
AND PEST-CONTROLLING AGENT CONTAINING THE SAME AS ACTIVE
INGREDIENT**

3

Publication number: JP2003040866**Publication date:** 2003-02-13**Inventor:** TANABE TOMOTSUGU; HOTTA HIROKI; TOTANI TETSUYA; HOSODA KATSUHIKO**Applicant:** NIPPON KAYAKU KK**Classification:****- international:** A01N43/38; A01N43/40; C07D209/12; C07D209/42; C07D401/04; C07D209/12; C07D209/42; A01N43/34; C07D209/00; C07D401/00; C07D209/00; (IPC1-7): C07D209/12; A01N43/38; A01N43/40; C07D209/42; C07D401/04**- european:****Application number:** JP20010230709 20010731**Priority number(s):** JP20010230709 20010731**Report a data error here****Abstract of JP2003040866****PROBLEM TO BE SOLVED:** To provide a new safe pest-controlling agent effective at a small amount.**SOLUTION:** This N-substituted indole derivative is represented by general formula (1) (wherein, X is N or CCl; R1 is a 1-6C alkyl group which may be substituted; R2 is H or a 1-6C alkyl group which may be substituted; R3 is H, a 1-6C alkyl group which may be substituted, a 1-6C alkoxy group which may be substituted; a halogen, NO₂ or CN; R4 is a 1-6C alkyl group which may be substituted, a 1-6C alkoxy group which may be substituted or a halogen; R5 is a 1-6C alkyl group which may be substituted, a 1-6C alkoxy group which may be substituted or a halogen; and n is 1 or 2).Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2003-40866

(P2003-40866A)

(43)公開日 平成15年2月13日(2003.2.13)

(51) Int.Cl.⁷
 C 07 D 209/12
 A 01 N 43/38
 43/40 101
 C 07 D 209/42
 401/04

F I
 C 07 D 209/12
 A 01 N 43/38
 43/40
 C 07 D 209/42
 401/04

テ-マコト^{*}(参考)
 4 C 06 3
 4 C 20 4
 101 M 4 H 01 1

審査請求 未請求 請求項の数9 OL (全19頁)

(21)出願番号 特願2001-230709(P2001-230709)

(22)出願日 平成13年7月31日(2001.7.31)

(71)出願人 000004086

日本化業株式会社
東京都千代田区富士見1丁目11番2号

(72)発明者 田辺 知嗣
埼玉県春日部市柏壁東3-4-21-204号
 (72)発明者 堀田 博樹
埼玉県さいたま市上落合6-8-25-204
 (72)発明者 戸谷 哲也
埼玉県さいたま市上落合6-7-8-201
 (72)発明者 鮎田 勝彦
埼玉県さいたま市蓮沼276-5

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 N置換インドール誘導体、その製造法及びそれを有効成分とする害虫防除剤

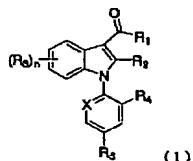
(57)【要約】

る、N置換インドール誘導体を開示する。

【課題】低薬量で有効かつ安全な新規防除剤の提供。

【解決手段】一般式(1)

【化1】

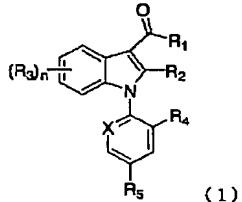


式中、例えば、XがNまたはCClを示し；R₁は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基を示し；R₂はHまたは置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基を示し；R₃はH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、ハロゲン、NO₂またはCNを示し；R₄は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；R₅は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；nは1または2で示され

【特許請求の範囲】

【請求項 1】一般式 (1)

【化1】



(1)

[式中XはNまたはCR₂を示し；R₁は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₂～C₆のアルケニル基、置換されていてもよいC₂～C₆のアルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキルチオ基またはNR₂；R₂を示し；R₃はH、ハロゲンまたは置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基を示し；R₄はH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₂～C₆のアルケニル基、置換されていてもよいC₂～C₆のアルキニル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキルチオ基、NR₂；R₅、ハロゲン、NO₂、CN、COR₃、CO₂R₃、CONR₂R₃、SO₂R₃、SO₃NR₂；R₆、SOR₃、SO₂R₃、OCOR₃、OCO₂R₃、OCONR₂R₃、OSO₂R₃、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、置換されていてもよいヘテロアリール基または置換されていてもよいヘテロアリールオキシ基を示し；R₇はH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキルチオ基、NR₂；R₈、ハロゲン、NO₂、CN、COR₃、CO₂R₃、CONR₂R₃、SO₂R₃、SO₃NR₂；R₉、SOR₃、SO₂R₃、OCOR₃、OCO₂R₃、OCONR₂R₃、OSO₂R₃、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいヘテロアリール基または置換されていてもよいヘテロアリールオキシ基を示し；R₁₀はH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、NR₂；R₁₁、ハロゲン、NO₂またはCNを示し；R₁₂はHまたはハロゲンを示し；R₁₃、R₁₄およびR₁₅はそれぞれ独立にH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基または置換されていてもよいフェニル基を示すが、R₁₃およびR₁₄で5～6員環を形成してもよく；nは1、2、3または4を示す。]で表されるN置換インドール誘導体。

【請求項2】XがN、CF、CClまたはCBrを示し；R₁は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキルチオ基またはNR₂；R₂を示し；R₃はHまたは置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基を示し；R₄はH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、ハロゲン、NO₂またはCNを示し；R₅は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、置換

されていてもよいアルキルチオ基、NR₁R₂またはハロゲンを示し；R₁は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、ハロゲン、NO₂またはCNを示し；R₂、R₃およびR₄はそれぞれ独立にH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基または置換されていてもよいフェニル基を示すが、R₂およびR₄で5～7員環を形成してもよく；nは1、2または3である請求項1に記載のN置換インドール誘導体。

【請求項3】 XがNまたはCCIを示し；R₁は置換されてい

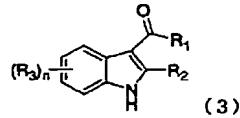
10 てもよいC₁～C₆のアルキル基を示し；R₂はHまたは置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基を示し；R₃はH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、ハロゲン、NO₂またはCNを示し；R₄は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；R₅は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；nは1または2である請求項1に記載のN置換インドール誘導体。

【請求項4】XがNまたはCCIを示し；R₁はハロゲンで置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基を示し；R₂はHまたはC₁～C₆のアルキル基を示し；R₃はH、ハロゲンで置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、ハロゲンで置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；R₄はハロゲンで置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、ハロゲンで置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；R₅はハロゲンで置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、ハロゲンで置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；nは1または2である請求項1に記載のN置換インドール誘導体。

【請求項5】XがNまたはCCIを示し；R₁はトリフルオロメチル基を示し；R₂はHまたはメチル基を示し；R₃はH、メチル基、トリフルオロメチル基またはハロゲンを示し；R₄はハロゲンを示し；R₅はトリフルオロメチル基またはハロゲンを示し；nは1である請求項1に記載のN置換インドール誘導体。

【請求項 6】一般式（3）

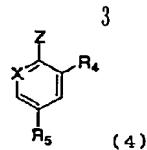
【化2】



(3)

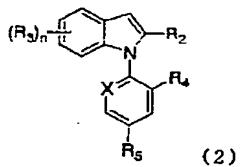
[式中 R_1 、 R_2 、 R_3 および n は請求項 1 で定義したものと同じものを示す] で表される化合物を一般式 (4)

【化 3】



[式中X、R₁およびR₂は請求項1で定義したものと同じものを示し、ZはハロゲンまたはR₁₀SO₃を示し、R₁₀は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基または置換されていてもよいC₁～C₆のアリール基を示す]で表される化合物と縮合反応させることを特徴とするか、又は一般式
(2)

【化4】



[式中R₂、R₃、R₄、R₅、Xおよびnは請求項1で定義したものと同じものを示す]で表される化合物を一般式
(6)

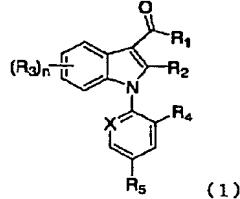
R₁COC₁ (6)

[式中R₁は請求項1で定義したものと同じものを示す]、または一般式 (7)

(R₁CO)₂O (7)

[式中R₁は請求項1で定義したものと同じものを示す]で表される化合物と反応させることを特徴とする、一般式 (1)

【化5】



[式中R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、Xおよびnは請求項1で定義したものと同じものを示す]で表されるN置換インドール誘導体の製造法。

【請求項7】請求項1～5のいずれか1項に記載のN置換インドール誘導体を有効成分として含有することを特徴とする殺虫剤組成物。

【請求項8】殺虫剤組成物の適用がダニ目である請求項7記載の殺虫剤組成物。

【請求項9】殺虫剤組成物の適用がネコノミである請求項7記載の殺虫剤組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は水田、畠地、果樹園、森林または環境衛生場面における害虫防除、人または動物の寄生虫防除に応用することのできるN置換イン

ドール誘導体、その製造法および組成物に関する。

【0002】

【従来の技術】米国特許出願第3290332号および特開昭55-151505にN置換インドール誘導体が記述されているが、これらは窒素上の置換基がアリールまたはピリジル基は含まれておらず、またその寄生虫に対する防除活性についても述べられていない。特開2000-26409においてはN-アリール／ヘテロアリール置換の複素環物質が記述されているが、インドール環上の置換基についてはアシル基等の置換基については述べられていない。米国特許出願第5599774号にはN置換インドール誘導体が記載されているが、本出願にはインドール環上にアシル基を置換した化合物については記載されておらず、またその用途は除草剤に限定されている。また、特開平6-92935におけるN置換インドール誘導体はインドール環上にスルフェニル基、スルファニル基またはスルフォニル基が結合したものであり、インドール環上の3位にカルボニルの結合した化合物については記載されていない。

【0003】

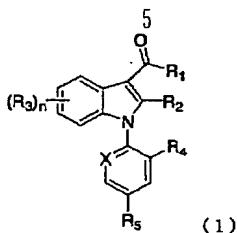
【発明が解決しようとする課題】農業分野および環境衛生分野での有害生物防除においては、従来用いられてきた有機リン系殺虫剤、カーバメート系殺虫剤、ピレスロイド系殺虫剤に対する抵抗性の発達が問題となっている。一方では、哺乳動物、天敵昆虫、環境に対して安全かつ負荷の少ないことも同時に要求されてきており、低薬量で有効かつ安全な新規防除剤の開発が望まれている。また近年、公衆衛生の飛躍的な改善により、伝染病やハエなどの衛生害虫発生率が大幅に減少したものの、依然としてヒトやペット（イヌ、ネコ等）、家畜類（ウシ、ブタ等）に寄生する寄生虫（ノミ、ダニ、線虫等）が問題となっている。これらを防除するための薬剤として、有機リン系殺虫剤、カーバメート系殺虫剤、ピレスロイド系殺虫剤、IGR剤、フィプロニル、イミダクロプリドなどの各種殺虫剤が使用されており、目的に応じて滴下液剤、噴霧剤、首輪、錠剤、チュアブル剤、顆粒剤、細粒剤、粉剤、シャンプー・リンス剤などの製剤を調整して使用している。しかしながらこれら防除剤は適用動物に対して高い安全性を提供しているとはいえず、またその防除効果および即効性の面に於いても、必ずしも十分ではない。

【0004】

【課題を解決するための手段】このような状況下、農業害虫防除、衛生害虫防除、寄生虫防除に関して銳意検討を重ねた結果、一般式 (1) で表される化合物群がこれら害虫に対して高い殺虫活性を示し、又動物への毒性が低く安全性が高いことを見出し、本発明に至った。即ち本発明は、(1) 一般式 (1)

【0005】

【化6】



【0006】 [式中XはNまたはCR₂を示し；R₁は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルケニル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキルチオ基またはNR₁R₂を示し；R₃はH、ハロゲンまたは置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基を示し；R₄はH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルケニル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキニル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキルチオ基、NR₁R₂、ハロゲン、NO₂、CN、COR₂、CO₂R₂、CONR₁R₂、SO₂R₂、SO₂NR₁R₂、SOR₂、SO₂R₂、OCOR₂、OCO₂R₂、OCONR₁R₂、OSO₂R₂、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、置換されていてもよいヘテロアリール基または置換されていてもよいヘテロアリールオキシ基を示し；R₅はH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキルチオ基、NR₁R₂、ハロゲン、NO₂、CN、COR₂、CO₂R₂、CONR₁R₂、SO₂R₂、SO₂NR₁R₂、SOR₂、SO₂R₂、OCOR₂、OCO₂R₂、OCONR₁R₂、OSO₂R₂、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、置換されていてもよいヘテロアリール基または置換されていてもよいヘテロアリールオキシ基を示し；R₆はH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；R₇は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；R₈は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；R₉は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；R₁₀は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示す。] で表されるN置換インドール誘導体、

【0007】 [2] XがN、CF₃、CCl₃またはCBr₃を示し；R₁は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキルチオ基またはNR₁R₂を示し；R₂はHまたは置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基を示し；R₃はH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、ハロゲン、NO₂またはCNを示し；R₄は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキルチオ基、NR₁R₂またはハロゲンを示し；R₅は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキルチオ基、NR₁R₂またはハロゲンを示す。]

ルコキシ基、ハロゲン、NO₂またはCNを示し；R₆、R₇およびR₈はそれぞれ独立にH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基または置換されていてもよいフェニル基を示すが、R₉およびR₁₀で5～7員環を形成してもよく；nは1、2または3である〔1〕に記載のN置換インドール誘導体、

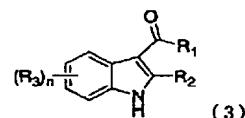
【0008】 [3] XがNまたはCCl₃を示し；R₁は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基を示し；R₂はHまたは置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基を示し；R₃はH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、ハロゲン、NO₂またはCNを示し；R₄は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；R₅は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；R₆はHまたは2である〔1〕に記載のN置換インドール誘導体、

【0009】 [4] XがNまたはCCl₃を示し；R₁はハロゲンで置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基を示し；R₂はHまたはC₁～C₆のアルキル基を示し；R₃はH、ハロゲンで置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、ハロゲンで置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；R₄はハロゲンで置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、ハロゲンで置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；R₅はハロゲンで置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、ハロゲンで置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基またはハロゲンを示し；nは1または2である〔1〕に記載のN置換インドール誘導体、

【0010】 [5] XがNまたはCCl₃を示し；R₁はトリフルオロメチル基を示し；R₂はHまたはメチル基を示し；R₃はH、メチル基、トリフルオロメチル基またはハロゲンを示し；R₄はハロゲンを示し；R₅はトリフルオロメチル基またはハロゲンを示し；R₆はHまたは1である〔1〕に記載のN置換インドール誘導体、

【0011】 [6] 一般式 (3)

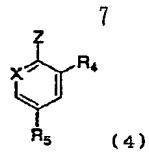
【化7】



【0012】 [式中R₁、R₂、R₃およびnは〔1〕で定義したものと同じものを示す] で表される化合物を一般式 (4)

【0013】

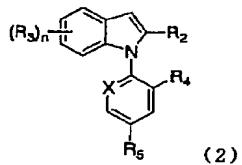
【化8】



【0014】 [式中X、R₁およびR₂は〔1〕で定義したものと同じものを示し、ZはハロゲンまたはR₁₀SO₃を示し、R₁₀は置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基または置換されていてもよいC₁～C₆のアリール基を示す]で表される化合物と縮合反応させることを特徴とするか、又は

【0015】一般式 (2)

【化9】



【0016】 [式中R₂、R₃、R₄、R₅、Xおよびnは〔1〕で定義したものと同じものを示す]で表される化合物を一般式 (6)

R₁COC₁ (6)

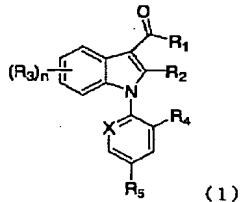
〔式中R₁は〔1〕で定義したものと同じものを示す〕、または一般式 (7)

(R₁CO)₂O (7)

〔式中R₁は〔1〕で定義したものと同じものを示す〕で表される化合物と反応させることを特徴とする、一般式 (1)

【0017】

【化10】



〔式中R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、Xおよびnは〔1〕で定義したものと同じものを示す〕で表されるN置換インドール誘導体の製造法、

【0018】 (7) 前記〔1〕～〔5〕のいずれか1項に記載のN置換インドール誘導体を有効成分として含有することを特徴とする殺虫剤組成物、

【0019】 (8) 殺虫剤組成物の適用がダニ目である〔7〕記載の殺虫剤組成物、〔9〕殺虫剤組成物の適用がネコノミである〔7〕記載の殺虫剤組成物に関する。

【0020】 次に本発明にかかる一般式 (1)～(4)、(6)～(7)における置換基X、R₁～R₁₀、Zおよびnの定義について説明する。

【0021】 一般式 (1)、(3)、(6)～(7)に

10

おけるR₁は、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₂～C₆のアルケニル基、置換されていてもよいC₂～C₆のアルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキルチオ基またはNR₂R₃を示す。

【0022】 R₁における「置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基」の「C₁～C₆のアルキル基」としては、例えば直鎖または分鎖のC₁～C₆のアルキル基であって、その好適な置換基としてはハロゲンが挙げられ、その具体例としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソブロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、トリクロロメチル基などが挙げられる。

R₁における「置換されていてもよいC₂～C₆のアルケニル基」の「C₂～C₆のアルケニル基」としては、例えば直鎖または分鎖のC₂～C₆のアルケニル基であって、その好適な置換基としてはハロゲンが挙げられ、具体例としては、ビニル基、トリクロロビニル基、アリル基、イソブロペニル基、ブテニル基、ペンテニル基、ヘキセニル基、スチリル基などが挙げられる。R₁における「置換されていてもよいC₂～C₆のアルキニル基」の「C₂～C₆のアルキニル基」としては、例えば直鎖または分鎖のC₂～C₆のアルキニル基であって、その好適な置換基としてはハロゲンが挙げられ、具体例としては、エチニル基、プロピニル基、ブチニル基、ペンチニル基などが挙げられる。

【0023】 R₁における「置換されていてもよいフェニル基」の好適な置換基としてはハロゲン、水酸基、C₁～C₆のアルキル基、ハロゲノC₁～C₆のアルキル基、C₁～C₆のアルコキシ基、ハロゲノC₁～C₆のアルコキシ基、ベンジルオキシ、フェノキシ等が挙げられ、具体例としては、フェニル基、ヒドロキシフェニル基、クロロフェニル基、メチルフェニル基、トリフルオロメチルフェニル基、メトキシフェニル基、tert-ブトキシフェニル基、ベンジルオキシフェニル基、トリフルオロメトキシフェニル基、フェノキシフェニル基などが挙げられる。R₁における「置換されていてもよいC₁～C₆のアルキルチオ基」の「C₁～C₆のアルキルチオ基」としては、例えば直鎖または分鎖のC₁～C₆のアルキルチオ基であって、その好適な置換基としてはハロゲン、フェニルが挙げられ、具体例としては、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、ブチルチオ基、ペンチルチオ基、ヘキシルチオ基、ベンジルチオ基、トリクロロメチルチオ基、モノフルオロジクロロメチルチオ基などが挙げられる。R₁は好ましくはメチル基、イソブロピル基、tert-ブチル基、クロロメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、ビニル基、スチリル基、フェニル基などが挙げられ、特に好ましくはトリフルオロメチル基である。

【0024】 一般式 (1)～(3)におけるR₂は、H、

20

30

30

40

40

40

40

40

40

50

ハロゲンまたは置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基を示す。R₁における「置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基」とはR₁における場合と同様であり、その具体例としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、プロモメチル基、トリクロロメチル基などが挙げられる。R₁は、好ましくは、Hまたはメチル基である。

【0025】一般式(1)～(3)におけるR₁は、H、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₂～C₆のアルケニル基、置換されていてもよいC₂～C₆のアルキニル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、置換されていてもよいアルキルチオ基、NR₁R₂、ハロゲン、NO₂、CN、COR₃、CO₂R₃、CONR₁R₂、SO₂R₃、SO₃NR₁R₂、SOR₃、SO₂R₃、OCOR₃、OCO₂R₃、OCONR₁R₂、OSO₂R₃、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、置換されていてもよいヘテロアリール基または置換されていてもよいヘテロアリールオキシ基を示す。R₁における「置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基」とはR₁における場合と同様であり、その具体例としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、プロモメチル基、トリクロロメチル基、ベンジル基などが挙げられる。R₁における「置換されていてもよいC₂～C₆のアルケニル基」とはR₁における場合と同様であり、その具体例としてはビニル基、アリル基、イソプロペニル基、ブテニル基、ペンテニル基、ヘキセニル基、スチリル基などが挙げられる。

【0026】R₁における「置換されていてもよいC₂～C₆のアルキニル基」とはR₁における場合と同様であり、その具体例としてはエチニル基、プロピニル基、ブチニル基、ペンチニル基などが挙げられる。R₁における「置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基」の「C₁～C₆のアルコキシ基」とは、例えば直鎖または分鎖のC₁～C₆のアルコキシ基であって、その好適な置換基としてはハロゲン、フェニルが挙げられ、具体例としてはメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、tert-ブトキシ基、トリフルオロメトキシ基、ベンジルオキシ基などが挙げられる。R₁における「置換されていてもよいC₁～C₆のアルキルチオ基」とはR₁における場合と同様であり、その具体例としてはメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、ブチルチオ基、ペンチルチオ基、ヘキシルチオ基、ベンジルチオ基、トリクロロメチルチオ基、モノフルオロジクロロメチルチオ基などが挙げられる。

【0027】R₁における「NR₁R₂」、「CONR₁R₂」、「SO₂NR₁R₂」および「OCONR₁R₂」のR₁とR₂は、それぞれ独立にH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基または置換されていてもよいフェニル基を示し、R₁およびR₂で

5～6員環を形成してもよい。「置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基」とはR₁での場合と同様であり、具体例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、プロモメチル基、トリクロロメチル基、ベンジル基などが挙げられる。「置換されていてもよいフェニル基」とはR₁での場合と同様であり、具体例としてはヒドロキシフェニル基、クロロフェニル基、メチルフェニル基、トリフルオロメチルフェニル基、メトキシフェニル基、tert-ブトキシフェニル基、ベンジルオキシフェニル基、トリフルオロメトキシフェニル基、フェノキシフェニル基などが挙げられる。また、R₁およびR₂によって形成できる5～6員環の具体例としては、ピロリジニル基、ピペリジニル基、モルホリノ基などが挙げられる。「NR₁R₂」の具体例としては、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、ジエチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基、ペンチルアミノ基、ヘキシルアミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アニリノ基などが挙げられる。「CONR₁R₂」の具体例としてはメチルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、ピロリジノカルボニル基、ビペリジノカルボニル基、モルホリノカルボニル基、アニリノカルボニル基などが挙げられる。「SO₂NR₁R₂」の具体例としてはスルファモイル基、メチルスルファモイル基、ジメチルスルファモイル基、エチルスルファモイル基、ジエチルスルファモイル基、プロピルスルファモイル基、イソプロピルスルファモイル基、ブチルスルファモイル基、tert-ブチルスルファモイル基、ペンチルスルファモイル基、ヘキシルスルファモイル基、ピロリジノスルファモイル基、ピペリジノスルファモイル基、モルホリノスルファモイル基、アニリノスルファモイル基などが挙げられる。「OCONR₁R₂」の具体例としては、メチルアミノカルボニルオキシ基、ジメチルアミノカルボニルオキシ基、エチルアミノカルボニルオキシ基、ジエチルアミノカルボニルオキシ基、ピロリジノカルボニルオキシ基、ビペリジノカルボニルオキシ基、モルホリノカルボニルオキシ基、アニリノカルボニルオキシ基などが挙げられる。

【0028】R₁における「ハロゲン」としてはフッ素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。R₁における「CO₂R₃」、「CO₂R₃」、「SO₂R₃」、「SOR₃」、「SO₃R₃」、「OCOR₃」、「OCO₂R₃」および「OSO₂R₃」のR₃は、R₃はそれぞれ独立にH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基または置換されていてもよいフェニル基を示す。「置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基」とはR₁での場合と同様であり、具体例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、tert-

ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、プロモメチル基、トリクロロメチル基、ベンジル基などが挙げられる。「置換されていてもよいフェニル基」とはR₁での場合と同様であり、具体例としてはヒドロキシフェニル基、クロロフェニル基、メチルフェニル基、トリフルオロメチルフェニル基、メトキシフェニル基、tert-ブトキシフェニル基、ベンジルオキシフェニル基、トリフルオロメトキシフェニル基、フェノキシフェニル基などが、それぞれ例示できる。「COR₂」の具体例としては、ホルミル基、アセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バレリル基、ピバロイル基、ベンゾイル基、トルオイル基、フラノイル基、ニコチノイル基、イソニコチノイル基、シンナモイル基などが挙げられる。「CO₂R₂」の具体例としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基などが、「SO₂R₂」の具体例としては、メトキシルフオニル基、エトキシルフオニル基、プロポキシルフオニル基、ブトキシルフオニル基、ベンジルオキシルフオニル基、フェノキシルフオニル基などが、「SOR₂」の具体例としては、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、ブロピルスルフィニル基、ブチルスルフィニル基、ベンジルスルフィニル基、フェニルスルフィニル基などが挙げられる。「SO₂R₂」の具体例としては、メチルスルフニル基、エチルスルフニル基、ブロピルスルフニル基、ブチルスルフニル基、ベンジルスルフニル基、フェニルスルフニル基などが挙げられる。「OCOR₂」の具体例としては、アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ブチリルオキシ基、イソブチリルオキシ基、バレリルオキシ基、ピバロイルオキシ基、ベンゾイルオキシ基、トルオイルオキシ基、フラノイルオキシ基、ニコチノイルオキシ基、イソニコチノイルオキシ基、シンナモイルオキシ基などが挙げられる。「OCO₂R₂」の具体例としては、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、プロポキシカルボニルオキシ基、ブトキシカルボニルオキシ基、tert-ブトキシカルボニルオキシ基、ベンジルオキシカルボニルオキシ基、フェノキシカルボニルオキシ基などが挙げられる。「OSO₂R₂」の具体例としては、メタンスルフニルオキシ基、エタンスルフニルオキシ基、プロパンスルフニルオキシ基、ブタンスルフニルオキシ基、ペンタンスルフニルオキシ基、ヘキサンスルフニルオキシ基、ベンゼンスルフニルオキシ基、トルエンスルフニルオキシ基などが挙げられる。

【0029】R₁における「置換されていてもよいフェニル基」とはR₁における場合と同様であり、その具体例としては、ヒドロキシフェニル基、クロロフェニル基、メ

チルフェニル基、トリフルオロメチルフェニル基、メトキシフェニル基、tert-ブトキシフェニル基、ベンジルオキシフェニル基、トリフルオロメトキシフェニル基、フェノキシフェニル基などが挙げられる。R₂における「置換されていてもよいフェノキシ基」の好適な置換基としてはハロゲン、水酸基、C₁～C₆のアルキル基、ハロゲノC₁～C₆のアルキル基、C₁～C₆のアルコキシ基、ハロゲノC₁～C₆のアルコキシ基、フェノキシ等が挙げられ、具体例としては、フェノキシ基、ヒドロキシフェノキシ基、クロロフェノキシ基、メチルフェノキシ基、トリフルオロメチルフェノキシ基、メトキシフェノキシ基、トリフルオロメトキシフェノキシ基、フェノキシフェノキシ基などが挙げられる。R₂における「置換されていてもよいヘテロアリール基」の「ヘテロアリール」とは環上にO、S、N等を有す1～3環の複素芳香環基を示し、置換基として例えばC₁～C₆のアルキル基、ハロゲン等によって置換されてもよく、具体例としては、フラニル基、チエニル基、アゾリル基、ピリジル基、インドリル基等が挙げられる。置換されていてもよいヘテロアリールオキシ基としてはの「ヘテロアリールオキシ基」とは環上にO、S、N等を有す1～3環の複素芳香環水酸基を示し、置換基として例えばC₁～C₆のアルキル基、ハロゲン等によって置換されてもよく、具体例としては、アゾリルオキシ基、ピリジルオキシ基、インドリルオキシ基などが挙げられる。R₂は好ましくは、H；メチル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基などの置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基；F、Clなどのハロゲン；または、メトキシ基、トリフルオロメトキシ基などの置換されてもよいC₁～C₆のアルコキシ基であり、特に好ましくはH、メチル基、トリフルオロメチル基、F、Clである。

【0030】R₁はH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、置換されていてもよいアルキルチオ基、NR₂R₃、ハロゲン、NO₂、CN、COR₂、CO₂R₂、CONR₂R₃、SO₂R₂、SO₂NR₂R₃、SOR₂、SO₂R₃、OCOR₂、OCO₂R₂、OCONR₂R₃、OSO₂R₂、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、置換されていてもよいヘテロアリール基または置換されていてもよいヘテロアリールオキシ基を示す。R₁における「置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基」とはR₁における場合と同様であり、その具体例としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、ベンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、プロモメチル基、トリクロロメチル基、ベンジル基などが挙げられる。R₁における「置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基」とはR₁における場合と同様であり、その具体例としては、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、tert-ブトキシ基、トリフルオロメトキシ基、ベンジルオキシ基

などが挙げられる。 R_1 における「置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキルチオ基」とは R_1 における場合と同様であり、その具体例としては、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、ブチルチオ基、ペンチルチオ基、ヘキシルチオ基、ベンジルチオ基、トリクロロメチルチオ基、モノフルオロジクロロメチルチオ基などが挙げられる。

【0031】 R_1 における「 NR_1R_2 」、「 $CONR_1R_2$ 」、「 $SO_2NR_1R_2$ 」および「 $OCONR_1R_2$ 」の R_1 と R_2 は、それぞれ独立にH、置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基または置換されていてもよいフェニル基を示し、 R_1 および R_2 で5~6員環を形成してもよい。「置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基」とは R_1 での場合と同様であり、具体例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソブロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、トリクロロメチル基、ベンジル基などが挙げられる。「置換されていてもよいフェニル基」とは R_1 での場合と同様であり、具体例としてはヒドロキシフェニル基、クロロフェニル基、メチルフェニル基、トリフルオロメチルフェニル基、メトキシフェニル基、tert-ブトキシフェニル基、ベンジルオキシフェニル基、トリフルオロメトキシフェニル基、フェノキシフェニル基などが挙げられる。また、 R_1 および R_2 によって形成できる5~6員環の具体例としては、ピロリジニル基、ピペリジニル基、モルホリノ基などが挙げられる。「 NR_1R_2 」の具体例としては、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、ジエチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソブロピルアミノ基、ブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基、ペンチルアミノ基、ヘキシルアミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アニリノ基などが挙げられる。「 $CONR_1R_2$ 」の具体例としては、メチルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、ピロリジノカルボニル基、ピペリジノカルボニル基、モルホリノカルボニル基、アニリノカルボニル基などが挙げられる。「 $SO_2NR_1R_2$ 」の具体例としては、スルファモイル基、メチルスルファモイル基、ジメチルスルファモイル基、エチルスルファモイル基、ジエチルスルファモイル基、プロピルスルファモイル基、イソブロピルスルファモイル基、ブチルスルファモイル基、tert-ブチルスルファモイル基、ペンチルスルファモイル基、ヘキシルスルファモイル基、ピロリジノスルファモイル基、ピペリジノスルファモイル基、モルホリノスルファモイル基、アニリノスルファモイル基などが挙げられる。「 $OCONR_1R_2$ 」の具体例としては、メチルアミノカルボニルオキシ基、ジメチルアミノカルボニルオキシ基、エチルアミノカルボニルオキシ基、ジエチルアミノカルボニルオキシ基、ピロリジノカルボニルオキシ基、ピペリジノカルボニルオキシ基、モ

ルホリノカルボニルオキシ基、アニリノカルボニルオキシ基などが挙げられる。

【0032】 R_1 における「ハロゲン」としてはフッ素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。 R_1 における「 CO_2R_1 」、「 CO_2R_2 」、「 SOR_1 」、「 SOR_2 」、「 $OCOR_1$ 」、「 OCO_2R_1 」および「 OSO_2R_1 」の R_1 は、 R_2 はそれぞれ独立にH、置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基または置換されていてもよいフェニル基を示す。「置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基」とは R_1 での場合と同様であり、具体例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソブロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、トリクロロメチル基などが挙げられる。「置換されていてもよいフェニル基」とは R_1 での場合と同様であり、具体例としてはヒドロキシフェニル基、クロロフェニル基、メチルフェニル基、トリフルオロメチルフェニル基、メトキシフェニル基、tert-ブトキシフェニル基、ベンジルオキシフェニル基、トリフルオロメトキシフェニル基、フェノキシフェニル基などが例示できる。「 COR_1 」の具体例としては、ホルミル基、アセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バレリル基、ビバロイル基、ベンゾイル基、トルオイル基、フラノイル基、ニコチノイル基、イソニコチノイル基、シンナモイル基などが挙げられる。「 CO_2R_1 」の具体例としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基などが挙げられる。「 SOR_1 」の具体例としては、メトキシルフォニル基、エトキシルフォニル基、プロポキシルフォニル基、ブトキシルフォニル基、ベンジルオキシルフォニル基、フェノキシルフォニル基などが挙げられる。「 $OCOR_1$ 」の具体例としては、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、プロピルスルフィニル基、ブチルスルフィニル基、ベンジルスルフィニル基、フェニルスルフィニル基などが挙げられる。「 OSO_2R_1 」としてはメチルスルフォニル基、エチルスルフォニル基、プロピルスルフォニル基、ブチルスルフォニル基、ベンジルスルフォニル基、フェニルスルフォニル基などが挙げられる。「 OCO_2R_1 」の具体例としては、アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ブチリルオキシ基、イソブチリルオキシ基、バレリルオキシ基、ビバロイルオキシ基、ベンゾイルオキシ基、トルオイルオキシ基、フラノイルオキシ基、ニコチノイルオキシ基、イソニコチノイルオキシ基、シンナモイルオキシ基などが挙げられる。「 OCO_2R_1 」としては、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、プロポキシカルボニルオキシ基、ブトキシカルボニルオキシ基、tert-ブトキシカルボニルオキシ基、ベンジルオキシカル

ボニルオキシ基、フェノキシカルボニルオキシ基などが挙げられる。「OSO₂R₂」の具体例としては、メタンスルフォニルオキシ基、エタンスルフォニルオキシ基、プロパンスルフォニルオキシ基、ブタンスルフォニルオキシ基、ペンタンスルフォニルオキシ基、ヘキサンスルフォニルオキシ基、ベンゼンスルフォニルオキシ基、トルエンスルフォニルオキシ基などが挙げられる。

【0033】R₁における「置換されていてもよいフェニル基」とはR₁における場合と同様であり、その具体例としては、ヒドロキシフェニル基、クロロフェニル基、メチルフェニル基、トリフルオロメチルフェニル基、メトキシフェニル基、tert-ブロキシフェニル基、ベンジルオキシフェニル基、トリフルオロメトキシフェニル基、フェノキシフェニル基などが挙げられる。R₁における「置換されていてもよいフェノキシ基」とはR₁における場合と同様であり、その具体例としては、フェノキシ基、ヒドロキシフェノキシ基、クロロフェノキシ基、メチルフェノキシ基、トリフルオロメチルフェノキシ基、メトキシフェノキシ基、トリフルオロメトキシフェノキシ基、フェノキシフェノキシ基などが挙げられる。R₁における「置換されていてもよいヘテロアリール基」とはR₁における場合と同様であり、その具体例としては、フラン基、チエニル基、アゾリル基、ピリジル基、インドリル基が挙げられ、置換されていてもよいヘテロアリールオキシ基とはR₁における場合と同様であり、その具体例としては、アゾリルオキシ基、ピリジルオキシ基、インドリルオキシ基などが挙げられる。R₁は好ましくは、H；メチル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基などの置換されいてもよいC₁～C₆のアルキル基；F、Cl、Iなどのハロゲン；または、メトキシ基、トリフルオロメトキシ基などの置換されいてもよいC₁～C₆のアルコキシ基であり、特に好ましくはClである。

【0034】一般式(1)～(2)、(4)におけるR₁はH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、NR₂R₃、ハロゲン、NO₂またはCNを示す。R₁における「置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基」とはR₁における場合と同様であり、その具体例としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、プロモメチル基、トリクロロメチル基などが挙げられる。R₁における「置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基」とはR₁における場合と同様であり、その具体例としては、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、tert-ブトキシ基、トリフルオロメトキシ基、ベンジルオキシ基などが挙げられる。

【0035】R₁における「NR₂R₃」のR₂とR₃は、それぞれ独立にH、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基または置換されていてもよいフェニル基を示し、R₁およ

びR₁で5～6員環を形成してもよい。「置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基」とはR₁での場合と同様であり、具体例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、プロモメチル基、トリクロロメチル基、ベンジル基などが挙げられる。「置換されていてもよいフェニル基」とはR₁での場合と同様であり、具体例としてはヒドロキシフェニル基、クロロフェニル基、メチルフェニル基、トリフルオロメチルフェニル基、メトキシフェニル基、tert-ブロキシフェニル基、ベンジルオキシフェニル基、トリフルオロメトキシフェニル基、フェノキシフェニル基などが例示できる。また、R₁およびR₂によって形成できる5～6員環の具体例としては、ピロリジル基、ピペリジニル基、モルホリノ基などが挙げられる。「NR₂R₃」の具体例としては、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、ジエチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基、ペンチルアミノ基、ヘキシルアミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アニリノ基などが挙げられる。

【0036】R₁における「ハロゲン」としては、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。R₁は好ましくは、F、Cl、Br、Iなどのハロゲン、トリフルオロメチル基などの置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基、または、トリフルオロメトキシ基などの置換されていてもよいC₁～C₆のアルコキシ基であり、特に好ましくはCl、トリフルオロメチル基である。

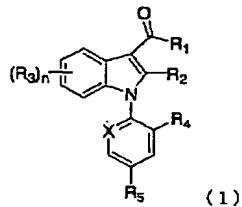
【0037】一般式(1)～(2)、(4)におけるX₃₀はNまたはCR₂を示し、R₂はHまたはハロゲンを示す。R₁における「ハロゲン」としては、F、Cl、Br、Iが挙げられる。X₃₀は好ましくは、NまたはCCl₄である。一般式(1)、(2)、(3)におけるnは1～4の整数であり、好ましくは1または2であり、特に好ましくは1である。

【0038】一般式(4)におけるZは、ハロゲンまたはR₁₀SO₃を示し、「ハロゲン」としてはCl、Br、Iなどが挙げられる。Zにおける「R₁₀SO₃」のR₁₀は、置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基または置換されていてもよいフェニル基を示す。「置換されていてもよいC₁～C₆のアルキル基」とはR₁における場合と同様であり、その具体例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、tert-ブチル基などが挙げられる。「置換されていてもよいフェニル基」とはR₁での場合と同様であり、具体例としてはクロロフェニル基、メチルフェニル基、トリフルオロメチルフェニル基、メトキシフェニル基、フェニル基などがそれぞれ例示できる。「R₁₀SO₃」の具体例としては、メタンスルフォニルオキシ基、ベンゼンスルフォニルオキシ基、トルエンスルフォニルオキシ基などが挙げられる。

【0039】一般式(1)の好ましい化合物としては表1に示す化合物が挙げられる。

【0040】表1

【化11】



*10

| No | X | R ₁ | R ₂ | R ₃ | R ₄ | R ₅ | n |
|----|-----|--|-----------------|--------------------|------------------|----------------------------------|---|
| 1 | N | CH ₃ | H | H | Cl | Cl | 1 |
| 2 | N | C ₂ H ₅ | H | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 3 | N | CH(CH ₃) ₂ | H | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 4 | N | C(CH ₃) ₃ | H | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 5 | N | cyclopropyl | CH ₃ | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 6 | N | cyclohexyl | H | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 7 | N | CF ₃ | H | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 8 | N | CCl ₃ | H | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 9 | N | CCl=CCl ₂ | H | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 10 | N | C ₆ H ₅ | H | H | Br | CF ₃ | 1 |
| 11 | N | 4-Cl-C ₆ H ₅ | H | H | Br | CH ₃ | 1 |
| 12 | N | NH ₂ | H | H | CF ₃ | CF ₃ | 1 |
| 13 | N | NHCH ₃ | CH ₃ | H | F | OCF ₃ | 1 |
| 14 | N | N(CH ₃) ₂ | H | H | F | cyclohexyl | 1 |
| 15 | N | N(C ₂ H ₅) ₂ | H | H | I | C(CH ₃) ₃ | 1 |
| 16 | N | NHC ₆ H ₅ | H | H | OCF ₃ | Cl | 1 |
| 17 | N | SCH ₃ | H | H | CF ₃ | CF ₃ | 1 |
| 18 | N | CH ₃ | H | 5-Cl | Cl | CF ₃ | 1 |
| 19 | N | C ₂ H ₅ | H | 5-CN | Cl | CF ₃ | 1 |
| 20 | N | CH(CH ₃) ₂ | H | 5-Br | Cl | CF ₃ | 1 |
| 21 | N | C(CH ₃) ₃ | H | 5-F | Cl | CF ₃ | 1 |
| 22 | N | cyclopropyl | H | 5-OCH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 23 | N | cyclohexyl | H | 5-NO ₂ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 24 | N | CF ₃ | H | 5-Cl | Cl | CF ₃ | 1 |
| 25 | N | CCl ₃ | H | 5-CH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 26 | N | CCl=CCl ₂ | H | 5-Br | Cl | CF ₃ | 1 |
| 27 | N | C ₆ H ₅ | H | 5-Cl, 6-Cl | Cl | CF ₃ | 2 |
| 28 | N | 4-Cl-C ₆ H ₅ | H | 6-F | CH ₃ | CF ₃ | 1 |
| 29 | N | NH ₂ | H | 6-Br | Cl | CF ₃ | 1 |
| 30 | N | NHCH ₃ | H | 6-CH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 31 | N | N(CH ₃) ₂ | H | 6-CN | OCF ₃ | CF ₃ | 1 |
| 32 | N | N(C ₂ H ₅) ₂ | H | 6-NO ₂ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 33 | N | NHC ₆ H ₅ | H | 6-OCH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 34 | N | SCH ₃ | H | 4-Cl | Cl | CF ₃ | 1 |
| 35 | CCl | CH ₃ | H | H | Cl | OCF ₃ | 1 |
| 36 | CCl | C ₂ H ₅ | H | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 37 | CCl | CH(CH ₃) ₂ | H | H | Cl | CF ₃ | 1 |

19

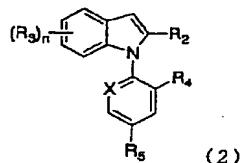
20

| | | | | | | | |
|----|-----|--|-----------------|-----------------------------------|------------------|----------------------------------|---|
| 38 | CCl | C(CH ₃) ₃ | H | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 39 | CCl | cyclopropyl | CH ₃ | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 40 | CCl | cyclohexyl | H | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 41 | CCl | CF ₃ | H | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 42 | CCl | CCl ₃ | H | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 43 | CCl | CCl=CCl ₂ | H | H | Br | CF ₃ | 1 |
| 44 | CCl | C ₆ H ₅ | H | H | Br | CF ₃ | 1 |
| 45 | CCl | 4-Cl-C ₆ H ₅ | H | H | Br | CH ₃ | 1 |
| 46 | CCl | NH ₂ | H | H | Br | CF ₃ | 1 |
| 47 | CCl | NHCH ₃ | CH ₃ | H | F | Cl | 1 |
| 48 | CCl | N(CH ₃) ₂ | H | H | F | cyclohexyl | 1 |
| 49 | CCl | N(C ₂ H ₅) ₂ | H | H | I | C(CH ₃) ₃ | 1 |
| 50 | CCl | NHC ₆ H ₅ | H | H | OCH ₃ | Cl | 1 |
| 51 | CCl | SCH ₃ | H | H | OCH ₃ | CF ₃ | 1 |
| 52 | CCl | CH ₃ | H | 5-Cl | Cl | CF ₃ | 1 |
| 53 | CCl | C ₂ H ₅ | H | 5-CN | Cl | CF ₃ | 1 |
| 54 | CCl | CH(CH ₃) ₂ | H | 5-Br | Cl | CF ₃ | 1 |
| 55 | CCl | C(CH ₃) ₃ | H | 5-F | Cl | CF ₃ | 1 |
| 56 | CCl | cyclopropyl | H | 5-OCH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 57 | CCl | cyclohexyl | H | 5-NO ₂ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 58 | CCl | CF ₃ | H | 5-Cl | Cl | CF ₃ | 1 |
| 59 | CCl | CCl ₃ | H | 5-CH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 60 | CCl | SCH ₃ | H | 7-Cl | Cl | CF ₃ | 1 |
| 61 | CCl | C ₆ H ₅ | H | 5-Cl, 6-Cl | Cl | CF ₃ | 2 |
| 62 | CCl | 4-Cl-C ₆ H ₅ | H | 6-F | CH ₃ | CF ₃ | 1 |
| 63 | CCl | NH ₂ | H | 6-Br | Cl | CF ₃ | 1 |
| 64 | CCl | NHCH ₃ | H | 6-CH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 65 | CCl | N(CH ₃) ₂ | H | 6-CN | Cl | CF ₃ | 1 |
| 66 | CCl | N(C ₂ H ₅) ₂ | H | 6-NO ₂ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 67 | CCl | NHC ₆ H ₅ | H | 6-CO ₂ CH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |

【0042】一般式(2)の好ましい化合物としては表2に示す化合物が挙げられる。

【0043】表2

【化12】



| | | | | | | | |
|----|----|---|--------------------|-------------------|----------------------------------|-----------------|---|
| 7 | N | H | H | CF ₃ | CF ₃ | 1 | |
| 8 | N | H | H | F | cyclohexyl | 1 | |
| 9 | N | H | H | I | C(CH ₃) ₃ | 1 | |
| 10 | N | H | H | CF ₃ | Cl | 1 | |
| 11 | N | H | 5-Cl | Cl | CF ₃ | 1 | |
| 12 | N | H | 5-CN | Cl | CF ₃ | 1 | |
| 13 | N | H | 5-Br | Cl | CF ₃ | 1 | |
| 14 | N | H | 5-F | Cl | CF ₃ | 1 | |
| 15 | N | H | 5-OCH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 | |
| 40 | 16 | N | H | 5-NO ₂ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 17 | N | H | 5-CH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 | |
| 18 | N | H | 5-Cl, 6-Cl | Cl | CF ₃ | 2 | |

【0044】

| No | X | R ₂ | R ₃ | R ₄ | R ₅ | n | 19 | N | H | 6-F | CH ₃ | CF ₃ | 1 |
|----|---|-----------------|----------------|----------------|------------------|----|----|-----|---|--------------------|------------------|-----------------|---|
| 1 | N | H | H | Cl | Cl | 1 | 20 | N | H | 6-Br | Cl | CF ₃ | 1 |
| 2 | N | H | H | Cl | CF ₃ | 1 | 21 | N | H | 6-CH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 3 | N | CH ₃ | H | Cl | CF ₃ | 1 | 22 | N | H | 6-CN | OCH ₃ | CF ₃ | 1 |
| 4 | N | H | H | Br | CF ₃ | 1 | 23 | N | H | 6-NO ₂ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 5 | N | H | H | Br | CH ₃ | 1 | 24 | N | H | 6-OCH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 6 | N | CH ₃ | H | F | OCF ₃ | 1 | 25 | CCl | H | H | Cl | Cl | 1 |
| | | | | | | 50 | 26 | CCl | H | H | Cl | CF ₃ | 1 |

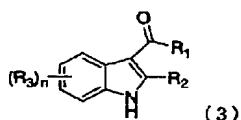
21

| | | | | | | |
|----|-----|-----------------|-----------------------------------|------------------|----------------------------------|---|
| 27 | CCl | CH ₃ | H | Cl | CF ₃ | 1 |
| 28 | CCl | H | H | Br | CF ₃ | 1 |
| 29 | CCl | H | H | Br | CH ₃ | 1 |
| 30 | CCl | CH ₃ | H | F | Cl | 1 |
| 31 | CCl | H | H | F | cyclohexyl | 1 |
| 32 | CCl | H | H | I | C(CH ₃) ₃ | 1 |
| 33 | CCl | H | H | OCF ₃ | Cl | 1 |
| 34 | CCl | H | 5-Cl | Cl | CF ₃ | 1 |
| 35 | CCl | H | 5-CN | Cl | CF ₃ | 1 |
| 36 | CCl | H | 5-Br | Cl | CF ₃ | 1 |
| 37 | CCl | H | 5-F | Cl | CF ₃ | 1 |
| 38 | CCl | H | 5-OCH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 39 | CCl | H | 5-NO ₂ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 40 | CCl | H | 5-CH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 41 | CCl | H | 7-Cl | Cl | CF ₃ | 1 |
| 42 | CCl | H | 5-Cl, 6-Cl | Cl | CF ₃ | 2 |
| 43 | CCl | H | 6-F | CH ₃ | CF ₃ | 1 |
| 44 | CCl | H | 6-Br | Cl | CF ₃ | 1 |
| 45 | CCl | H | 6-CH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 46 | CCl | H | 6-CN | Cl | CF ₃ | 1 |
| 47 | CCl | H | 6-NO ₂ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 48 | CCl | H | 6-OCH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |
| 49 | CCl | H | 6-CO ₂ CH ₃ | Cl | CF ₃ | 1 |

【0045】一般式(3)の好ましい化合物としては表3に示す化合物が挙げられる。

【0046】表3

【化13】



(12)

22

| | | | | | | |
|----|-----|--|--|--------------------|-------------------|---|
| 16 | N | NHC ₆ H ₅ | H | H | 1 | |
| 17 | N | SCH ₃ | H | H | 1 | |
| 18 | N | CH ₃ | H | 5-Cl | 1 | |
| 19 | N | C ₂ H ₅ | H | 5-CN | 1 | |
| 20 | N | CH(CH ₃) ₂ | H | 5-Br | 1 | |
| 21 | N | C(CH ₃) ₃ | H | 5-F | 1 | |
| 22 | N | cyclopropyl | H | 5-OCH ₃ | 1 | |
| 23 | N | cyclohexyl | H | 5-NO ₂ | 1 | |
| 24 | N | CF ₃ | H | 5-Cl | 1 | |
| 10 | 25 | N | CCl ₃ | 5-CH ₃ | 1 | |
| 26 | N | CCl=CCl ₂ | H | 5-Br | 1 | |
| 27 | N | C ₆ H ₅ | H | 5-Cl, 6-Cl | 2 | |
| 28 | N | 4-Cl-C ₆ H ₅ | H | 6-F | 1 | |
| 29 | N | NH ₂ | H | 6-Br | 1 | |
| 30 | N | NHCH ₃ | H | 6-CH ₃ | 1 | |
| 31 | N | N(CH ₃) ₂ | H | 6-CN | 1 | |
| 32 | N | N(C ₂ H ₅) ₂ | H | 6-NO ₂ | 1 | |
| 33 | N | NHC ₆ H ₅ | H | 6-OCH ₃ | 1 | |
| 34 | CCl | CH ₃ | H | H | 1 | |
| 20 | 35 | CCl | C ₂ H ₅ | H | 1 | |
| 36 | CCl | CH(CH ₃) ₂ | H | H | 1 | |
| 37 | CCl | C(CH ₃) ₃ | H | H | 1 | |
| 38 | CCl | cyclopropyl | CH ₃ | H | 1 | |
| 39 | CCl | cyclohexyl | H | H | 1 | |
| 40 | CCl | CF ₃ | H | H | 1 | |
| 41 | CCl | CCl ₃ | H | H | 1 | |
| 42 | CCl | CCl=CCl ₂ | H | H | 1 | |
| 43 | CCl | C ₆ H ₅ | H | H | 1 | |
| 44 | CCl | 4-Cl-C ₆ H ₅ | H | H | 1 | |
| 30 | 45 | CCl | NH ₂ | H | 1 | |
| 46 | CCl | NHCH ₃ | CH ₃ | H | 1 | |
| 47 | CCl | N(CH ₃) ₂ | H | H | 1 | |
| 48 | CCl | N(C ₂ H ₅) ₂ | H | H | 1 | |
| 49 | CCl | NHC ₆ H ₅ | H | H | 1 | |
| 50 | CCl | SCH ₃ | H | H | 1 | |
| 51 | CCl | CH ₃ | H | 5-Cl | 1 | |
| 52 | CCl | C ₂ H ₅ | H | 5-CN | 1 | |
| 53 | CCl | CH(CH ₃) ₂ | H | 5-Br | 1 | |
| 54 | CCl | C(CH ₃) ₃ | H | 5-F | 1 | |
| 40 | 55 | CCl | cyclopropyl | 5-OCH ₃ | 1 | |
| 56 | CCl | cyclohexyl | H | 5-NO ₂ | 1 | |
| 57 | CCl | CF ₃ | H | 5-Cl | 1 | |
| 58 | CCl | CCl ₃ | H | 5-CH ₃ | 1 | |
| 59 | CCl | SCH ₃ | H | 7-Cl | 1 | |
| 60 | CCl | C ₆ H ₅ | H | 5-Cl, 6-Cl | 2 | |
| 61 | CCl | 4-Cl-C ₆ H ₅ | H | 6-F | 1 | |
| 62 | CCl | NH ₂ | H | 6-Br | 1 | |
| 63 | CCl | NHCH ₃ | H | 6-CH ₃ | 1 | |
| 64 | CCl | N(CH ₃) ₂ | H | 6-CN | 1 | |
| 50 | 65 | CCl | N(C ₂ H ₅) ₂ | H | 6-NO ₂ | 1 |

【0047】

| No. | X | R1 | R2 | R3 | n |
|-----|---|--|-----------------|----|---|
| 1 | N | CH ₃ | H | H | 1 |
| 2 | N | C ₂ H ₅ | H | H | 1 |
| 3 | N | CH(CH ₃) ₂ | H | H | 1 |
| 4 | N | C(CH ₃) ₃ | H | H | 1 |
| 5 | N | cyclopropyl | CH ₃ | H | 1 |
| 6 | N | cyclohexyl | H | H | 1 |
| 7 | N | CF ₃ | H | H | 1 |
| 8 | N | CCl ₃ | H | H | 1 |
| 9 | N | CCl=CCl ₂ | H | H | 1 |
| 10 | N | C ₆ H ₅ | H | H | 1 |
| 11 | N | 4-Cl-C ₆ H ₅ | H | H | 1 |
| 12 | N | NH ₂ | H | H | 1 |
| 13 | N | NHCH ₃ | CH ₃ | H | 1 |
| 14 | N | N(CH ₃) ₂ | H | H | 1 |
| 15 | N | N(C ₂ H ₅) ₂ | H | H | 1 |

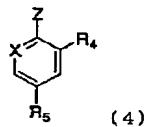
24

| | | | | | |
|----|-----|------------------------------------|---|-----------------------------------|---|
| 66 | CCl | NH(C ₆ H ₅) | H | 6-OCH ₃ | I |
| 67 | CCl | SCH ₃ | H | 6-CO ₂ CH ₃ | I |

【0048】一般式(4)の好ましい化合物としては表4に示す化合物が挙げられる。

【0049】表4

【化14】



(4)

【0050】

| No | X | Z | R ₄ | R ₅ |
|----|-----|----------------------------------|------------------|----------------------------------|
| 1 | N | Cl | Cl | Cl |
| 2 | N | Cl | Cl | CF ₃ |
| 3 | N | Cl | Cl | CH ₃ |
| 4 | N | Cl | Cl | OCF ₃ |
| 5 | N | Cl | F | Cl |
| 6 | N | Cl | Cl | C(CH ₃) ₃ |
| 7 | N | Cl | F | C(CH ₃) ₃ |
| 8 | N | Cl | Br | CF ₃ |
| 9 | N | Br | Br | CH ₃ |
| 10 | N | Br | F | CF ₃ |
| 11 | N | OSO ₂ CH ₃ | F | cyclohexyl |
| 12 | N | OSO ₂ CH ₃ | I | C(CH ₃) ₃ |
| 13 | N | OCONH ₂ | I | CF ₃ |
| 14 | N | Cl | OCF ₃ | CF ₃ |
| 15 | N | Cl | OCH ₃ | CF ₃ |
| 16 | N | Cl | CH ₃ | CF ₃ |
| 17 | CCl | Cl | Cl | Cl |
| 18 | CCl | Cl | Cl | CF ₃ |
| 19 | CCl | Cl | Cl | CH ₃ |
| 20 | CCl | Cl | Cl | OCF ₃ |
| 21 | CCl | Cl | F | CF ₃ |
| 22 | CCl | Cl | Cl | C(CH ₃) ₃ |
| 23 | CCl | Cl | F | C(CH ₃) ₃ |
| 24 | CCl | Cl | Br | CF ₃ |
| 25 | CCl | Br | Br | CH ₃ |
| 26 | CCl | Br | F | CF ₃ |
| 27 | CCl | OSO ₂ CH ₃ | F | cyclohexyl |
| 28 | CCl | OSO ₂ CH ₃ | I | C(CH ₃) ₃ |
| 29 | CCl | OCONH ₂ | I | Cl |
| 30 | CCl | Cl | OCF ₃ | CF ₃ |
| 31 | CCl | Cl | OCH ₃ | CF ₃ |
| 32 | CCl | Cl | CH ₃ | CF ₃ |

【0051】一般式(6)の好ましい具体例としては、CH₃COCl、C₆H₅COCl、(CH₃)₂CCOCl、(CH₃)₂CHCOCl、CF₃COCl、CCl₃COCl、c-C₆H₅COCl、c-C₆H₁₁COCl、C₆H₅COCl、

50

(13)

などが挙げられる。一般式(7)の好ましい具体例としては、(CH₃CO)₂O、(C₆H₅CO)₂O、((CH₃)₂CCO)₂O、((CH₃)₂CHCO)₂O、(CF₃CO)₂O、(CCl₃CO)₂O、(c-C₆H₅CO)₂O、(c-C₆H₁₁CO)₂O、(C₆H₅CO)₂O、(4-Cl-C₆H₄CO)₂O、(CH₃OCO)₂O、(C₆H₅OCO)₂Oおよび(C₆H₅COCO)₂Oなどが挙げられる。

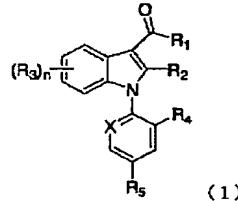
【0052】

【発明の実施の形態】以下、本発明を詳細に説明する。本発明の一般式(1)で表されるN置換インドール誘導体は、次に示すように合成ルート1や合成ルート2によって製造することができるが、これら製造法に限定されるものではない。

【0053】【合成ルート1】一般式(3)および一般式(4)で示される化合物から一般式(1)で示されるN置換インドール誘導体の製造；

【0054】一般式(1)

【化15】

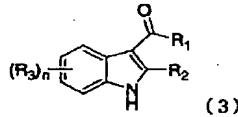


20

【式中R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、Xおよびnは前記で定義したものと同じものを示す】で表されるN置換インドール誘導体は、一般式(3)

【0055】

【化16】

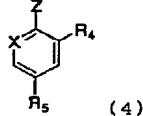


30

【式中R₁、R₂、R₃およびnは前記で定義したものと同じものを示す】で表される化合物と一般式(4)

【0056】

【化17】



40

【式中X、Z、R₄およびR₅は前記で定義したものと同じものを示す】で表される化合物を、溶媒中塩基の存在下縮合させることにより合成することができる。

【0057】本合成法の出発物質となる一般式(3)および一般式(4)で示される化合物は、従来公知の方法により合成することができる(J. Org. Chem., (1985), 89, 5451; Chem. - Ztg., (1986), 307; J. Heterocycl. Chem., (1988), 25, 469;

Synthesis and Chemistry of Agrochemicals IV, ACS Symposium Series 584, (1995) pp 443。一般式(4)で表される化合物の使用量は、一般式(3)で表される化合物に対して、通常0.5~2当量、好ましくは0.8~1.2当量である。上記反応に用いる溶媒としては反応に不活性なものであれば何れでもよく、例えばヘキサンなどの脂肪族炭化水素、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素、ジクロロメタン、クロロベンゼンなどのハロゲン化炭化水素、メタノールやエタノールなどの脂肪族低級アルコール、酢酸エチルエステル、酢酸ブチルエステルなどの脂肪族エスチル、テトラヒドロフランなどのエーテル系炭化水素、N,N-ジメチルホルムアミドなどのアミド類、アセトニトリルなどのニトリル類、ジメチルスルフォキシドなどのスルフォキシド類、水及びそれらの混合物が挙げられる。

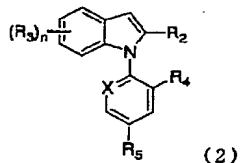
【0058】塩基としては例えば、KOHやNaOHなどのアルカリ金属水酸化物、K₂CO₃やNa₂CO₃などのアルカリ金属炭酸塩、MeONaやEtONaやt-BuOKなどの脂肪族低級アルコールのアルカリ金属塩、NaHなどのアルカリ金属水素化物、ピリジンやトリエチルアミンなどの有機塩基、Triton Bなどの4級アンモニウム塩等などであり、好ましくはアルカリ金属水酸化物、アルカリ金属炭酸塩、脂肪族低級アルコールのアルカリ金属塩、有機塩基である。特にピリジンやトリエチルアミンなどの有機塩基などの場合は、大過剰に用いて溶媒として使用することもできる。またその使用量は一般式(3)で表される化合物に対して通常0.5から10当量であり、好ましくは0.8から5当量である。反応温度は通常-20℃から溶媒還流温度であり、好ましくは0℃から80℃である。また、得られた一般式(1)で表されるN置換インドール誘導体はそのままでも用いることができるが、再結晶、蒸留およびシリカゲル等を用いたクロマトグラフィーなどの通常用いられる方法により精製することができる。

【0059】[合成ルート2]

第1工程：一般式(3)および一般式(4)で示される化合物から一般式(2)で示される化合物の製造；

【0060】一般式(2)

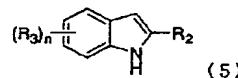
【化18】



【式中R₂、R₃、R₄、R₅、Xおよびnは前記で定義したものと同じものを示す】で表される化合物は、米国特許出願第5599774号や特開平6-92935号公報に記載の方法などにより、一般式(5)

【0061】

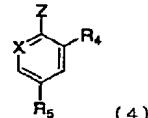
【化19】



【式中R₂、R₃およびnは前記で定義したものと同じものを示す】で表される化合物を一般式(4)

【0062】

【化20】



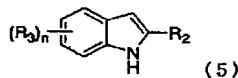
【式中X、Z、R₄およびR₅は前記で定義したものと同じものを示す】で表される化合物を、溶媒中塩基の存在下縮合させることにより合成することができる。

【0063】本合成法の出発物質となる一般式(4)および一般式(5)で示される化合物は、従来公知の方法に準じて合成することができる。

【0064】一般式(5)の好ましい化合物としては表5に示す化合物が挙げられる。

【0065】表5

【化21】



【0066】

| No | R ₂ | R ₃ | n |
|----|-----------------|-----------------------------------|---|
| 1 | H | H | 1 |
| 2 | CH ₃ | H | 1 |
| 3 | H | 5-Cl | 1 |
| 4 | CH ₃ | 5-CN | 1 |
| 5 | H | 5-Br | 1 |
| 6 | H | 5-F | 1 |
| 7 | CH ₃ | 5-OCH ₃ | 1 |
| 8 | H | 5-NO ₂ | 1 |
| 9 | H | 5-CH ₃ | 1 |
| 10 | H | 5-Cl, 6-Cl | 2 |
| 11 | H | 6-Cl | 1 |
| 12 | CH ₃ | 6-F | 1 |
| 13 | H | 6-Br | 1 |
| 14 | H | 6-CH ₃ | 1 |
| 15 | H | 6-CN | 1 |
| 16 | CH ₃ | 6-NO ₂ | 1 |
| 17 | H | 6-OCH ₃ | 1 |
| 18 | H | 4-Cl | 1 |
| 19 | H | 7-Cl | 1 |
| 20 | H | 6-CO ₂ CH ₃ | 1 |

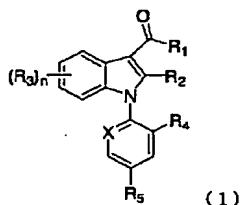
【0067】一般式(4)で表される化合物の使用量は、一般式(5)で表される化合物に対して、通常0.5~2当量、好ましくは0.8~1.2当量である。上記反応に用いる溶媒としては反応に不活性なものであれば何れでもよく、例えばヘキサンなどの脂肪族炭化水素、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素、ジクロロメタン、クロロベンゼンなどのハロゲン化炭化水素、メタノールやエタノールなどの脂肪族低級アルコール、酢酸エチルエステル、酢酸ブチルエステルなどの脂肪族エステル、テトラヒドロフランなどのエーテル系炭化水素、N,N-ジメチルホルムアミドなどのアミド類、アセトニトリルなどのニトリル類、ジメチルスルフォキシドなどのスルフォキシド類、水及びそれらの混合物が挙げられる。

【0068】塩基としては例えば、KOHやNaOHなどのアルカリ金属水酸化物、K₂CO₃やNa₂CO₃などのアルカリ金属炭酸塩、MeONaやEtONaやt-BuOKなどの脂肪族低級アルコールのアルカリ金属塩、NaHなどのアルカリ金属水素化物、ピリジンやトリエチルアミンなどの有機塩基、Triton Bなどの4級アンモニウム塩等などであり、好ましくはアルカリ金属水酸化物、アルカリ金属炭酸塩、脂肪族低級アルコールのアルカリ金属塩、有機塩基である。特にピリジンやトリエチルアミンなどの有機塩基などの場合は、大過剰に用いて溶媒として使用することもできる。またその使用量は一般式(5)で表される化合物に対して通常0.5から10当量であり、好ましくは0.8から5当量である。反応温度は通常-20℃から溶媒還流温度であり、好ましくは0℃から80℃である得られた一般式(2)で表されるN置換インドール誘導体はそのままで次の第2工程に供することができるが、再結晶、蒸留およびシリカゲル等を用いたクロマトグラフィーなどの通常用いられる方法により精製した後、供することもできる。

【0069】第2工程：一般式(2)で示される化合物から一般式(1)で示される化合物の製造；

【0070】一般式(1)

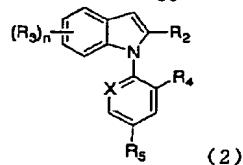
【化22】



【式中R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、Xおよびnは前記で定義したものと同じものを示す】で表されるN置換インドール誘導体は、一般式(2)

【0071】

【化23】



【式中R₁、R₂、R₃およびnは前記で定義したものと同じものを示す】で表される化合物を、一般式(6)

R₁COCl (6)

10 [式中R₁は前記で定義したものと同じものを示す]、または一般式(7)

(R₁CO)₂O (7)

【式中R₁は前記で定義したものと同じものを示す】で示される化合物と触媒の存在下反応させることにより合成することができる。

【0072】本合成法で用いられる一般式(6)または一般式(7)で示される化合物は、従来公知の方法により合成することができる。一般式(6)または一般式(7)で表される化合物の使用量は、一般式(2)で表される化合物に対して、通常0.8~3当量、好ましくは1~2当量である。上記反応に用いる溶媒としては反応に不活性なものであれば何れでもよく、例えばジクロロメタン、クロロベンゼンなどのハロゲン化炭化水素、ニトロメタン、ニトロトルエンなどのニトロ化合物、二硫化炭素、およびそれらの混合物が挙げられる。触媒としては、酸クロライドや酸無水物を使ったFriedel-Crafts反応等のアシル化反応に用いられる触媒が挙げられ、ルイス酸触媒、例えばAlCl₃などのアルミニウム化合物、TiCl₄などのチタン化合物、SnCl₄などのスズ化合物、BF₃などのホウ素化合物、ZnCl₂などの亜鉛化合物や、フッ化水素、硫酸、ポリリン酸などのブレンステッド酸触媒が挙げられる。またその使用量は一般式(6)で表される化合物または一般式(7)で表される化合物に対して通常0.5から10当量であり、好ましくは0.8から5当量である。反応温度は通常-20℃から溶媒還流温度であり、好ましくは0℃から100℃であるまた、得られた一般式(1)で表されるN置換インドール誘導体はそのままでも用いることができるが、精製法としては再結晶、蒸留およびシリカゲル等を用いたクロマトグラフィーなどの通常用いられる方法により精製することができる。

30 【0073】本発明の一般式(1)で表されるN置換インドール誘導体（以下、本化合物と称する）を農用および衛生場面で使用する場合、使用目的に応じてそのままかまたは効果を助長あるいは安定にするために農薬補助剤を混用して、農薬製造分野において一般的に行われている方法により、粉剤、細粒剤、粒剤、水和剤、フロアブル剤、乳剤、マイクロカプセル剤、油剤、エアゾール、加熱燻蒸剤（蚊取り線香、電気蚊取りなど）、フォッキングなどの煙霧剤、非加熱燻蒸剤、毒餌などの任意の製剤形態の組成物にして使用することができる。

40 【式中R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、Xおよびnは前記で定義したものと同じものを示す】で表されるN置換インドール誘導体（以下、本化合物と称する）を農用および衛生場面で使用する場合、使用目的に応じてそのままかまたは効果を助長あるいは安定にするために農薬補助剤を混用して、農薬製造分野において一般的に行われている方法により、粉剤、細粒剤、粒剤、水和剤、フロアブル剤、乳剤、マイクロカプセル剤、油剤、エアゾール、加熱燻蒸剤（蚊取り線香、電気蚊取りなど）、フォッキングなどの煙霧剤、非加熱燻蒸剤、毒餌などの任意の製剤形態の組成物にして使用することができる。

【0074】これらの種種の製剤は実際の使用に際しては、直接そのまま使用するか、または水で所望の濃度に希釈して使用することができる。ここに言う農薬補助剤として担体（希釈剤）およびその他の補助剤、例えば接着剤、乳化剤、湿展剤、分散剤、固着剤、崩壊剤等を挙げることができる。液体担体としては、トルエン、キレンなどの芳香族炭化水素、ブタノール、オクタノール、グリコールなどのアルコール類、アセトンなどのケトン類、ジメチルホルムアミドなどのアミド類、ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド類、メチルナフタレン、シクロヘキサン、動植物油、脂肪酸、脂肪酸エステルなど、または灯油、軽油などの石油分留物や水などが挙げられる。固体担体としては、クレー、カオリン、タルク、珪藻土、シリカ、炭酸カルシウム、モンモリロナイト、ペントナイト、長石、石英、アルミナ、鋸屑などが挙げられる。

【0075】また乳化剤、分散剤としては通常界面活性剤が使用され、例えば高級アルコール硫酸ナトリウム、ステアリルトリメチルアンモニウムクロライド、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ラウリルベタインなどの陰イオン系界面活性剤、陽イオン系界面活性剤、非イオン系界面活性剤、両イオン系界面活性剤が挙げられる。また展着剤としてはポリオキシエチレンノニルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンラウリルエーテルなどが挙げられ、湿展剤としてはポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルジアルキルスルホサクシネットなどが挙げられ、固着剤としてカルボキシメチセルロース、ポリビニルアルコールなどが挙げられ、崩壊剤としてはリグニンスルホン酸ナトリウム、ラウリル硫酸ナトリウムなどが挙げられる。

【0076】さらにこれら本発明化合物は2種以上の配合使用によって、より優れた殺虫活性を発現させることも可能であり、また他の生理活性物質、殺虫剤としては例えばアレスリン、フタルスリン、パーメスリン、デカメスリン、フェンバレート、シクロプロトリンなどのピレスロイド系化合物、DDVP、フェニトロチオン、ダイアジノン、テメホスなどの有機リン系化合物、NAC、MTM C、BPMC、ピリマーなどのカーバメート系化合物、テブフェノジド、クロマフェノジドなどのヒドラジン系化合物、クロルフルアズロンなどのベンゾイルウレア系化合物、昆虫ホルモン剤、BT剤などが挙げられ、その他殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物成長調節剤、肥料、その他の農薬などと混合することによりさらに効力の優れた多目的組成物をつくることもでき、また相乗効果も期待することができる。さらに例えばピペルニルブトキサイド、サルホキサイド、サフロキサンなどのピレスロイド系殺虫剤用の共力剤として知られているものを加えることにより、この効果を数倍増強させることも可能となる。また、本発明化合物は光、熱、酸化等に安定性が高いが、必要に応じて酸化防止剤あるいは紫外線吸

収剤、例えばBHT、BHAのようなフェノール類、 α -ナフチルアミンなどのアリールアミン類、あるいはベンゾフェノン系化合物を安定剤として適宜加えることによって、より効果の安定した組成物を得ることができる。本発明組成物中の有効成分含有量は剤形態、施用方法、その他の条件により異なり、場合によっては有効成分化合物のみでもよいが、通常は0.2~95%（重量）、好ましくは0.5~80%（重量）の範囲である。

【0077】本発明の化合物の使用量は剤形、施用する方法、時期、その他の条件によって変化するが、農園芸用剤、森林害虫用剤および牧野害虫用剤は通常10アール当たり有効成分量で10~300g、好ましくは15~200gが使用され、衛生害虫用剤は通常1m²当たり有効性分量で2~200mg、好ましくは5~100mgが使用される。たとえば粉剤は10アール当たり有効成分で15~120g、粒剤は有効成分で30~240g、また乳剤、水和剤は有効成分で40~250gの範囲である。しかしながら特別の場合には、これらの範囲を超えることが、または下回ることが可能であり、また同時に必要でさえある。本化合物を殺寄生虫剤として用いる場合、N置換インドール誘導体のみをそのまま用いてもよいが、より効果的には、寄生虫を最も簡便かつ効果的に防除するために、これら化合物群の滴下液剤、液剤、噴霧剤、泡状製剤、錠剤、顆粒剤、細粒剤、粉剤、カプセル剤、注射剤、座剤、チュアブル剤、シャンプー・リンス剤、首輪、飼料との混合剤など殺寄生虫剤として許容される製剤を調製し、獣医学的に公知の方法にて全身的または非全身的に適用動物に投与することが好ましく、液化滴剤、噴霧剤が特に好適な製剤である。

【0078】上記製剤中、例えば液化滴剤は、本化合物0.1~20重量部およびグリコールまたはグリコールモノアルキルエーテル10~95重量部含有する液状の経皮吸収剤であり、必要により適宜他の成分を含有させることができる。例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、tert-ブタノール、ベンジルアルコール等のアルコール類、炭酸プロピレン、N-メチル-2-ピロリドン、水等の液状担体であり、グリコールまたはグリコールモノアルキルエーテルと容易に溶解するものである。これらは本防除剤中に1~85重量部、好ましくは3~70重量部含有し得る。本防除剤の動物への適用量は動物1頭当たり、組成物として通常0.001~10mlであり、本化合物量としては0.1~300mgである。また噴霧剤は、本化合物0.1~20重量部、グリコール類、アルコール類および界面活性剤を10~95重量部含有する液状の外部寄生虫駆虫剤であるが、必要により適宜、他の成分を含有し得る。例えば、グリコール類としては、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、プロピレングリコール、グリコールモノアルキルエーテルを例示することができ、アルコール類としては、メタノール、エタノール、イソプロパノール、tert-ブタノール、ベンジルアルコール

などを例示することができる。界面活性剤としては、高級アルコール硫酸ナトリウム、ステアリルメチルアンモニウムクロライド、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ラウリルベタインなどの陰イオン系界面活性剤、陽イオン系界面活性剤、両性イオン系界面活性剤があげられる。本防除剤の動物への施用量は適用する動物あたり、組成物として通常0.01~100ml程度、本化合物量として、0.1~300mg程度である。

【0079】その他の製剤についても、一般的に知られている界面活性剤、希釈剤、添加剤、安定剤など、組成物の調整に必要とされる成分を加えてつくることができる。

【0080】本発明の殺虫剤は他の殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、共力剤、動物用飼料と混合または併用することもできる。これらの例としては、例えばダイアジノンやDDVPなどの有機リン系化合物、カルボスルファンなどのカーバメート系化合物、シクロプロトリン、エトフェンプロクス、アレスリン、パーメスリンなどのビレスロイド系化合物、イミダクロプリドなどのクロロニコチニル系化合物、フィプロニルなどのフェニルピラゾール系化合物、ルフェヌロンなどのベンゾイルウレア系化合物、メトブレン、ピリプロキシフェンなどの幼若ホルモン類似化合物、クロマフェノジド、テブフェノジドなどのヒドラジン系化合物、ミルベマイシン、イベルメクチン、モキシデクチン、セラメクチンなどのマクロライド系化合物、その他プロフェジン、アザディラクチンなどが挙げられる。上記製剤の投与方法については、各々の製剤において行われている通常の方法にて実施することができ、また動物に対する本化合物の投与量としては、0.1mg~300mg/kgであり、好ましくは1mg~200mgであり、特に好ましくは10~100mgである。

【0081】本化合物の投与間隔は、その有効成分が動物の体内に有効量残留し、目的とする効果を十分發揮できる期間を設定する必要があり、このため各製剤によって異なる。例えば滴下液剤では投与間隔は1ヶ月から1年であり、好ましくは1ヶ月から6ヶ月であり、特に好ましくは1ヶ月から3ヶ月である。

【0082】本発明の殺虫組成物の適用できる具体的な害虫名を以下に挙げる。半翅目(Hemiptera)としては、例えばツマグロヨコバイ(*Nephrotettix cincticeps*)、セジロウンカ(*Sogate furcifera*)、トビイロウンカ(*Nilaparvatalugens*)、ヒメトビウンカ(*Laodelphax striatellus*)、ホソヘリカメムシ(*Riptortus clavatus*)、ミナミアオカメムシ(*Nezaraviridula*)、ナシグンバイ(*Stephanitis nashi*)、オンシツコナジラミ(*Trialeurodes vaporariorum*)、ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、ヤノネカカイガラムシ(*Unaspis yanonensis*)、鱗翅目(Lepidoptera)としてはキンモンホソガ(*Phyllonorycter ringoneella*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、ワタミガ(*Promalactis inonisema*)、リンゴカクモンハマキ(*Adoxophyes orana*)、マメシンクイガ(*Leguminivora glycinvorella*)、コブノメイガ(*Canaphalocrocis medinalis*)、ニカメイガ(*Chilo suppressalis*)、アワノメイガ(*Ostrinia furnacalis*)、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)、アワヨトウ(*Pseudaletia separata*)、ハスモンヨトウ(*Spodopteralitura*)、イネツトムシ(*Parnara guttata*)、モンシロチョウ(*Pieris rapae crucivora*)、ヘリオチス(*Heliothis spp.*)、鞘翅目(Coleoptera)としては例えばドウガネブイブイ(*Anomala cuprea*)、マメコガネ(*Popillia japonica*)、イネゾウムシ(*Echinocnemus soqameus*)、イネミズゾウムシ(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、イネドロオイムシ(*Oulema oryzae*)、ヒメマルカツオブシムシ(*Anthrenus verbasic*)、コクヌスト(*Tenebrioides mauritanicus*)、コクゾウムシ(*Sitophilus zeamis*)、ニジュウヤホシテントウ(*Henosepilachna vigintioctopunctata*)、アズキゾウムシ(*Callosobruchus chinensis*)、マツノマダラカミキリ(*Monochamus alternatus*)、ウリハムシ(*Aulacophora femoralis*)、レプチノタルサ・デセムリネアタ(*Leptinotarsa decemlineata*)、フェドン・コクレアリアエ(*Phaedon cochlearias*)、ジアプロチカ(*Diabrotica spp.*)、膜翅目(Hymenoptera)としては例えばカブラハバチ(*Athalia rosae japonensis*)、ルリチュウレンジハバチ(*Argesimilis*)、双翅目(Diptera)としては例えばネッタタイエカ(*Culex pipiens fatigans*)、ネッタイシマカ(*Aedes aegypti*)、ダイズサヤタマバエ(*Asphondylls spp.*)、タネバエ(*Hylemyaplatura*)、イエバエ(*Musca domestica vicina*)、ウリミバエ(*Dacus cucurbitae*)、イネハモグリバエ(*Agromyzaoryzae*)、キンバエ(*Lucilia spp.*)、ノイエバエ(*Musca harvei*)、クロイエバエ(*MuscaBezzii*)、ノサシバエ(*Haematobia irritans*)、ツメトゲブユ(*Simuliumiwatens*)、ウシヌカカ(*Culicoides oxystoma*)、ウシアブ(*Tabanuschrurus*)、アカイエカ(*Culex pipiens*)、ヒトスジシマカ(*Aedes albopictus*)、総翅目(Thysanoptera)としては例えばチャノキイロアザミウマ(*Scirtothrips dorsalis*)、ネギアザミウマ(*Thrips tabaci*)、ミナミキイロアザミウマ(*Thrips palmi*)、イネアザミウマ(*Baliothrips biformis*)、シラミ目(Anoplura)としては例えばコロモジラミ(*Pediculus humanus corporis*)、ケジラミ(*Pthirus pubis*)、ウジシラミ(*Haematopinus eurysternus*)、ヒツジシラミ(*Damalina ovis*)、チャタテムシ目(Pscoptera)としては例えばコチャタテ(*Trogium pulsatorium*)、ヒラタチャタテ(*Liposcelis bostrychophilus*)、直翅目としては例えばケラ(*Gryllotalpa africana*)、トノサマバッタ(*Locusta migratoria*)、コバネイナゴ(*Oxya*

50 ヨウ)、ワタミガ(*Promalactis inonisema*)、リンゴカクモンハマキ(*Adoxophyes orana*)、マメシンクイガ(*Leguminivora glycinvorella*)、コブノメイガ(*Canaphalocrocis medinalis*)、ニカメイガ(*Chilo suppressalis*)、アワノメイガ(*Ostrinia furnacalis*)、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)、アワヨトウ(*Pseudaletia separata*)、ハスモンヨトウ(*Spodopteralitura*)、イネツトムシ(*Parnara guttata*)、モンシロチョウ(*Pieris rapae crucivora*)、ヘリオチス(*Heliothis spp.*)、鞘翅目(Coleoptera)としては例えばドウガネブイブイ(*Anomala cuprea*)、マメコガネ(*Popillia japonica*)、イネゾウムシ(*Echinocnemus soqameus*)、イネミズゾウムシ(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、イネドロオイムシ(*Oulema oryzae*)、ヒメマルカツオブシムシ(*Anthrenus verbasic*)、コクヌスト(*Tenebrioides mauritanicus*)、コクゾウムシ(*Sitophilus zeamis*)、ニジュウヤホシテントウ(*Henosepilachna vigintioctopunctata*)、アズキゾウムシ(*Callosobruchus chinensis*)、マツノマダラカミキリ(*Monochamus alternatus*)、ウリハムシ(*Aulacophora femoralis*)、レプチノタルサ・デセムリネアタ(*Leptinotarsa decemlineata*)、フェドン・コクレアリアエ(*Phaedon cochlearias*)、ジアプロチカ(*Diabrotica spp.*)、膜翅目(Hymenoptera)としては例えばカブラハバチ(*Athalia rosae japonensis*)、ルリチュウレンジハバチ(*Argesimilis*)、双翅目(Diptera)としては例えばネッタタイエカ(*Culex pipiens fatigans*)、ネッタイシマカ(*Aedes aegypti*)、ダイズサヤタマバエ(*Asphondylls spp.*)、タネバエ(*Hylemyaplatura*)、イエバエ(*Musca domestica vicina*)、ウリミバエ(*Dacus cucurbitae*)、イネハモグリバエ(*Agromyzaoryzae*)、キンバエ(*Lucilia spp.*)、ノイエバエ(*Musca harvei*)、クロイエバエ(*MuscaBezzii*)、ノサシバエ(*Haematobia irritans*)、ツメトゲブユ(*Simuliumiwatens*)、ウシヌカカ(*Culicoides oxystoma*)、ウシアブ(*Tabanuschrurus*)、アカイエカ(*Culex pipiens*)、ヒトスジシマカ(*Aedes albopictus*)、総翅目(Thysanoptera)としては例えばチャノキイロアザミウマ(*Scirtothrips dorsalis*)、ネギアザミウマ(*Thrips tabaci*)、ミナミキイロアザミウマ(*Thrips palmi*)、イネアザミウマ(*Baliothrips biformis*)、シラミ目(Anoplura)としては例えばコロモジラミ(*Pediculus humanus corporis*)、ケジラミ(*Pthirus pubis*)、ウジシラミ(*Haematopinus eurysternus*)、ヒツジシラミ(*Damalina ovis*)、チャタテムシ目(Pscoptera)としては例えばコチャタテ(*Trogium pulsatorium*)、ヒラタチャタテ(*Liposcelis bostrychophilus*)、直翅目としては例えばケラ(*Gryllotalpa africana*)、トノサマバッタ(*Locusta migratoria*)、コバネイナゴ(*Oxya*

ezoensis)、チャバネゴキブリ (Blattella germanica)、クロゴキブリ (Periplaneta fuliginosa) などが挙げられ、隠翅目 (Aphaniptera) としては例えばヒトノミ (Pulex irritans)、ネコノミ (Ctenocephalides felis)、イヌノミ (Ctenocephalides canis)、ケオプスネズミノミ (Xenopsylla cheopis)、トゲノミの一種 (Ceratophyllus spp.) などが挙げられ、ダニ目としては例えばフトタゲチマダニ (Haemaphysalis longicornis)、オウシマダニ (Boophilus microplus)、ミミヒゼンダニ*

* の一種 (Otodectes spp.)、イエダニの一種 (Ornithonyssus spp.)、ツツガムシの一種 (Trombicula spp.)、イヌセンコウヒゼンダニの一種 (Sarcoptes spp.)、ネコショウセンコウヒゼンダニの一種 (Notoedres spp.)、リビセファラスの一種 (Rhipicephalus spp.) などが挙げられる。

【0083】また、本発明の殺虫組成物が適用できる寄生虫およびそれによる病気を次に要約するが、これらに限定されるものではない。

| 病名 | 寄生虫 |
|--|---|
| Bilharziosis または Schistosomiasis | Schistosoma mansoni, S. Japonicum, S. Haematobium (住血吸虫) |
| Ancylostomiasis | Necator americanus, Ancylostoma duodenale (鉤虫、線虫) |
| Ascariasis | Ascaris lumbricoides (回虫、線虫) |
| Filariasis または Elephantiasis | Wuchereria bancrofti, Brugia malayi (線虫) |
| Onchoceriasis または River blindness Loiasis | Onchocerca volvulus (線虫)、 Loa loa (眼糸状虫、線虫) |

【0084】また、本発明化合物が適用される対象動物としては、ヒト、牛や豚、羊、ニワトリなどの家畜や、イヌやネコ、マウス、ラット、ハムスター、リス、ウサギ、フェレット、アヒル、ハト、小鳥類などの小動物などが挙げられる。

【0085】

【実施例】以下に実施例を示し、本発明をさらに具体的に説明する

【0086】参考合成例：1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)インドール
インドール (2.0g) をジメチルホルムアミド (20ml) に溶解し、氷冷、窒素気流下で60%水素化ナトリウム (690mg) を添加した後、ジメチルホルムアミド n (4ml) に溶解した 2, 3-ジクロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン (3.7g) を氷冷下に滴下した。滴下終了後60℃まで加热し、同温にて2.5時間攪拌した。室温とした後、反応溶液を水中に注ぎ、酢酸エチルエステルにて抽出した。有機層を水にて洗浄した後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n -ヘキサン/酢酸エチルエステル = 3 0 / 1) で精製し、目的とする 1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)インドール (4.85g、収率95%)を得た。融点: 52-53℃

【0087】実施例1：1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-トリフルオロアセチルインドール (以下単にNo.7と記す。) を所定濃

アセチルインドールの合成 (表1における化合物No. 7)

1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)インドール (1.0g) をCH₂Cl₂ (100ml) に溶解し、室温にて無水トリフルオロ酢酸 (1.06g) を滴下した。4時間加熱還流した後、無水トリフルオロ酢酸 (1.06g) を室温にて追加し、さらに4時間加熱還流した。室温とした後、反応溶液に水 (20ml) を加え、有機層を分取した。有機層をMgSO₄ で乾燥後、溶媒留去した。得られた残留物をカラムクロマトグラフィーに付し、 n -ヘキサン/AcOEt (20:1) 流分より 1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-トリフルオロアセチルインドール (1.15g、収率87%) を白色固体として得た。 $m.p.$ 64-66℃

40 ジメチルスルホキサソード85重量部、キシレン85重量部、ニューカルゲン900 (竹本油脂社製) 20重量部を混合溶解した。この混合溶液90重量部に得られた 1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-トリフルオロアセチルインドール10量部を混合し乳剤とした。

【0088】生物試験例1：ネコノミ成虫に対する効果 (死虫率)

実施例1にて得られた 1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-トリフルオロアセチルインドール (以下単にNo.7と記す。) を所定濃

度になるようにアセトン溶液に溶解し、0.1mlを直径2.8cm、高さ12cmのガラスチューブの底に滴下し、風乾した。風乾後、ネコノミ成虫10匹をガラスチューブに入れナイロンメッシュで蓋をし、室温：26℃、湿度：80%条件下に静置した。1日後、2日後に、生死を判定し、死虫率を算出した。対照薬剤としてアレスリン [(RS)-3-Allyl-2-methyl-4-oxocyclopent-2-enyl (1R)S cis, trans-2, 2-dimethyl-3-(2-methylprop-1-enyl)cyclopropanecarboxylate] を用い、同様に死虫率を算出した。その試験結果を表6に示す。

【0089】

表6

| 供試化合物 | 濃度 μg/tube | 1日後 | | 2日後 | |
|-----------|---------------|-----|-----|-----|----|
| | | 死亡 | 死亡 | 死亡 | 死亡 |
| No7 | 10 | 100 | 100 | | |
| | 1 | 100 | 100 | | |
| | 0.1 | 10 | 100 | | |
| Allethrin | 10 | 100 | 100 | | |
| | 1 | 0 | 0 | | |
| 対照 | - | 0 | 0 | | |

【0090】生物試験例2：フタトゲチマダニに対する効果

No7の乳剤をネオグラミン0.01%添加した水道水にて表に示した濃度に希釈した。その希釈液に市販の0.5X15cmのバストールピペットを30秒間浸漬し、綿に垂直に立てて風乾した。風乾したバストールピペットの頭部に綿を詰め、綿を詰めた端より、吸引ポン*

表8

| 供試化合物 | 投与量 (mg/kg) | 累積死亡数 (死亡数/供試数) | | | |
|--------|----------------|-----------------|-----|-----|------|
| | | 3時間後 | 1日後 | 7日後 | 14日後 |
| No7 | 30 | 0/5 | 0/5 | 0/5 | 0/5 |
| | 100 | 0/5 | 0/5 | 0/5 | 0/5 |
| | 300 | 0/5 | 0/5 | 0/5 | 0/5 |
| フィプロニル | 30 | 0/5 | 1/5 | 1/5 | 1/5 |
| | 100 | 1/5 | 5/5 | 5/5 | 5/5 |

【0094】

【発明の効果】本発明によれば、農業分野および環境衛生分野における有害生物を、低薬量で有効に防除するこ※40

* プにてマダニ孵化幼虫を10匹吸引し、先端をパテで封じた。吸引後ピペットはNa₂HPO₄の飽和溶液を入れたデンケータ内に静置し、23℃で保存した。観察は2日後、4日後に実施した。その結果を表7に示す。

【0091】

表7

| 供試化合物 | 濃度 μg/tube | 2日後 | | 4日後 | |
|-----------|---------------|-----|-----|-----|----|
| | | 死亡 | 死亡 | 死亡 | 死亡 |
| No7 | 10 | 100 | 100 | | |
| | 1 | 100 | 100 | | |
| Allethrin | 10 | 100 | 100 | | |
| | 1 | 0 | 0 | | |
| 対照 | - | 0 | 0 | | |

【0092】生物試験例3：マウスにおける急性毒性試験

No7をオリブ油に所定濃度になるように溶解し、ゾンデを用いてstd:ddy系雄マウスに直接胃内に10ml/kg投与した。投与薬量は30、100、300mg/kgとした。投与3時間後、1、7、14日後に、生死数を計測した。比較としてフィプロニル [(±)-5-Amino-1-(2,6-dichloro- α , α -trifluoro-p-toly1)-4-trifluoromethylsulfinylpyrazole-3-carbonitrile] を用い、同様に生死数を計測した。その結果を表8に示す。

【0093】

フロントページの続き

F ターム(参考) 4C063 AA01 BB02 CC12 DD06 EE03
 4C204 BB02 CB03 DB16 DB24 DB26
 EB03 FB14
 4H011 AC01 AC02 AC04 BA01 BA05
 BB09 BC01 BC07 DA16